

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
22 juillet 2004 (22.07.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/060968 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C08G 69/10, 69/48, A61K 47/48, 9/50

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/003458

(22) Date de dépôt international :
24 novembre 2003 (24.11.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/15269 4 décembre 2002 (04.12.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :
FLAMEL TECHNOLOGIES [FR/FR]; 33, avenue du
Docteur Georges Lévy, F-69200 Vénissieux (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : ANGOT,
Stéphanie [FR/FR]; 123 bis, cours Albert Thomas,

F-69003 Lyon (FR). CHAN, You-Ping [FR/FR]; 14,
boulevard Jean XXIII, F-69008 Lyon (FR). SOULA,
Gérard [FR/FR]; 33, rue Nungesser, F-69330 Meyzieu
(FR).

(74) Mandataires : CABINET PLASSERAUD etc.; 65/67,
rue de la Victoire, F-75440 Paris Cedex 09 (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT,
RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR,
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (BW, GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK,
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: POLYAMINO ACIDS FUNCTIONALIZED BY AT LEAST ONE (OLIGO)AMINO ACID GROUP AND THERAPEU-
TIC USES

(54) Titre : POLYAMINOACIDES FONCTIONNALISÉS PAR AU MOINS UN GROUPEMENT (OLIGO)AMINOACIDE ET
LEURS APPLICATIONS NOTAMMENT THÉRAPEUTIQUES

(57) Abstract: The invention relates to novel biodegradable polyamino acid based materials which can be used for the vectorization of (an) active substance (s) (PA). The invention also relates to novel pharmaceutical, cosmetic, dietary or phytosanitary compositions based on said polyamino acids. The aim of the invention is to provide a novel polymer raw material which can be used for the vectorization of active substances and which can meet all required specifications in said area: biocompatibility, biodegradability, ability to become easily associated with many active substances or the ability to solubilize them, and the ability to release said active substances in vivo. This is achieved in the present invention which primarily relates to polyamino acids comprising aspartic units and/or glutamic units some of which bearing at least one graft, characterized in that at least one of said grafts is joined to an aspartic or glutamic unit by means of an amide bond and in that at least one of said grafts comprises at least one oligoamino acid which is Leu, and/or Ileu, and/or Val, and/or Phe based. Said amide functions ensure better stability with respect to hydrolysis than for similar products of prior art. Advantageously, said polymers can be easily and economically transformed into active substance vectorization particles, said particles being able to form stable aqueous colloidal suspensions.

(57) Abrégé : La présente invention concerne des nouveaux matériaux à base de polyaminoacides biodégradables, utiles notamment pour la vectorisation de principe(s) actif(s) (PA). L'invention vise aussi de nouvelles compositions pharmaceutiques, cosmétiques, diététiques ou phytosanitaires à base de ces polyaminoacides. Le but de l'invention est de fournir une nouvelle matière première polymère, susceptible d'être utilisée pour la vectorisation de PA et permettant de satisfaire de manière optimale à toutes les spécifications requises en l'espèce: biocompatibilité, biodégradabilité, aptitude à s'associer facilement avec de nombreux principes actifs ou à les solubiliser, et à libérer ces principes actifs in vivo. Ce but est atteint par la présente invention qui concerne tout d'abord des polyaminoacides comprenant des unités aspartiques et/ou des unités glutamiques, dont certaines sont porteuses d'au moins un greffon, caractérisé en ce qu'au moins un de ces greffons est relié à une unité aspartique ou glutamique, par l'intermédiaire d'une liaison amide et en ce qu'au moins une partie de ces greffons comprend au moins un oligoaminoacide à base de Leu, et/ou Ileu, et/ou Val, et/ou Phe. Ces fonctions amides assurent une meilleure stabilité à l'hydrolyse que les produits analogues de l'art antérieur. Avantageusement, ces polymères sont aussi aptes à se transformer aisément et économiquement en particules de vectorisation de principes actifs, ces particules étant elles même propres à former des suspensions colloïdales aqueuses stables.

WO 2004/060968 A1



Publiée :

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.